## PATENT COOPERATION TREATY

# PCT/EP2003/009818 526 568

### **PCT**

### INTERNATIONAL PRELIMINARY EXAMINATION REPORT

Rec'd PCT/PTO 04 MAR 2005	10/526568
PATENT COOPER PA	PCT/EP2003/0 RATION TREATY  526 5
INTERNATIONAL PRELIMIN	ARY EXAMINATION REPORT
(PCT Article 3	36 and Rule 70)
Applicant's or agent's file reference 30989P WO FOR FURTHER AC	TION See Notification of Transmittal of Internation Preliminary Examination Report (Form PCT/IPEA/41
International application No. PCT/EP2003/009818  International filing date 04 September 200	
International Patent Classification (IPC) or national classification and C07C 253/30	IPC
Applicant DEGUS	SA AG
3. This report contains indications relating to the following it  I Basis of the report  II Priority  III Non-establishment of opinion with regard  Lack of unity of invention	ems:  to novelty, inventive step and industrial applicability  with regard to novelty, inventive step or industrial applicability;  h statement
	Date of completion of this report
Date of submission of the demand  19 February 2004 (19.02.2004)	12 January 2005 (12.01.2005)
Name and mailing address of the IPEA/EP	Authorized officer



### International application No. INTERNATIONAL PRELIMINARY EXAMINATION REPORT

### PCT/EP2003/009818

I. Basis of the report					
1. With regard to the elements of the international application:*					
	the inte	rnational application as originally filed			
$\overline{\boxtimes}$	the desc	eription:			
	pages	2, 8-10	, as originally filed		
	pages		, filed with the demand		
	pages	1, 3, 4, 5, 5a, 6, 7, filed with the letter of	01 September 2004 (01.09.2004)		
	the clai	me	i		
	pages		, as originally filed		
	pages	, as amended (together	er with any statement under Article 19		
	pages		, filed with the demand		
	pages	1-9 , filed with the letter of	01 September 2004 (01.09.2004)		
l 🖂	the dra				
			, as originally filed		
	pages pages		, filed with the demand		
1	pages	, filed with the letter of			
		•	·		
	•	ence listing part of the description:	ac originally filed		
	pages		, filed with the demand		
	pages	, filed with the letter of			
1	pages				
2. With	h regard	to the language, all the elements marked above were available or furnished to a continuous filed, unless otherwise indicated under this item.			
The	se eleme	nts were available or furnished to this Authority in the following language	which is:		
	the la	nguage of a translation furnished for the purposes of international search (under	Rule 23.1(b)).		
		nguage of publication of the international application (under Rule 48.3(b)).			
	the la	nguage of the translation furnished for the purposes of international prelimina	ry examination (under Rule 55.2 and/		
1	or 55.	•			
3. Win	th regard liminary	to any nucleotide and/or amino acid sequence disclosed in the internexamination was carried out on the basis of the sequence listing:	national application, the international		
	. conta	ined in the international application in written form.			
	filed	together with the international application in computer readable form.			
	furnis	shed subsequently to this Authority in written form.			
1 [		shed subsequently to this Authority in computer readable form.			
	intern	statement that the subsequently furnished written sequence listing does relational application as filed has been furnished.			
		statement that the information recorded in computer readable form is identic furnished.	cal to the written sequence listing has		
4.	The .	amendments have resulted in the cancellation of:			
* -		the description, pages			
	H	the claims, Nos.			
	H	the drawings, sheets/fig			
	لــا	•	the short have been acceptanted as a con-		
5.	This beyon	report has been established as if (some of) the amendments had not been made and the disclosure as filed, as indicated in the Supplemental Box (Rule 70.2(c)).**	, since they have been considered to go		
in and	this rep d 70.17).	nt sheets which have been furnished to the receiving Office in response to an incort as "originally filed" and are not annexed to this report since they do	not comain unenaments (Nuie 70.10		
** An	y replace	ement sheet containing such amendments must be referred to under item $ 1 $ and $ a $	nnexed to this report.		

#### INTERNATIONAL PRE-MINARY EXAMINATION REPORT

		•
In ational application No.		
PCT/EP	03/09818	¥.

ş.

: -

7.	Reasoned statement under Article 35(2) with regard to novelty citations and explanations supporting such statement	inventive step or industrial applicability
•	citations and explanations supporting such statement	, inventive step or industrial applica

Statement			
Novelty (N)	Claims	1-9	YES
	Claims		NO
Inventive step (IS)	, Claims	1-9	YES
	Claims		NO
Industrial applicability (IA)	Claims	1-9	YES
	Claims		NO

#### 2. Citations and explanations

D1: US-A-3 567 758

D2: TETRAHEDRON, vol. 39, no. 1, 1983, pages 193-197

D3: GB-A-1 065 936

D4: GB-A-1 442 250.

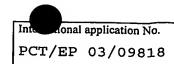
The present application fails to meet the requirements of PCT Article 33(2) because the subject matter of the claims lacks novelty. The application relates to a method for the catalyst-free production of cyanophenols from methoxybenzonitriles, using an <u>alkali alcoholate</u> at temperatures of between 80°C and 230°C.

In contrast to the present application, D1 discloses a method whereby 4-methoxybenzonitrile, for example (see D1, example 1), is reacted with sodium phenolate.

The present application satisfies the requirement of PCT Article 33(3) since the subject matter of the claims involves an inventive step.

The problem addressed by the application is that of "developing a method for the catalyst-free production of cyanophenols, which method makes it possible to produce

### INTERNATIONAL PRELIMINARY EXAMINATION REPORT



high yields of the desired product in an environmentally friendly manner, with little waste and using advantageous raw materials" (see page 6, lines 1-5).

The above problem is solved by an appropriate method, the substituted methoxybenzonitrile of the general formula (I) being reacted with an alkali alcoholate at temperatures of between 80°C and 230°C.

D1 is considered to be the closest prior art. As stated above, D1 discloses a method using sodium phenolate. This use of phenolates, instead of alcoholates, has the following disadvantages: "phenolates are considerably more expensive than alcoholates and the use of phenolates as coupling products gives rise to very large amounts of waste phenol ethers which, moreover, cannot be utilised" (applicant's letter of 1 September 2004, page 3, "Inventive step", paragraph 2).

The use of phenolates according to D1 cannot be readily transferred to alkali alcoholates.

D2 discloses the reaction of dichlorobenzenes with sodium ethoxide, the corresponding chloranisoles being thereby produced. Nowhere in said document is there any mention of the possibility of extending the method disclosed therein to other substituted aromatic compounds, such as nitriles for example. Since D2 relates exclusively to halogenised, and in particular chlorinated, phenols and does not refer to nitriles or cyanophenols, there was no inducement for a person skilled in the art to combine document D2 with document D1.

## VERTRAGUBER DIE INTERNATIONALE ZUSAMMENARB GEBIET DES PATENTWES REC REO'D' 13 JAN 2005

**PCT** 

WIPO

FOT

## INTERNATIONALER VORLÄUFIGER PRÜFUNGSBERICHT

(Artikel 36 und Regel 70 PCT)

			•				
Aktenzeichen des Anmelders oder Anwalts mk23170			Anmelders oder Anwalts	WEITERES VORG	EHEN slehe Mitteilung vorläufigen Prü	g über die Übersendung des internationalen Ifungsberichts (Formblatt PCT/IPEA/416)	
Internationales Aktenzeichen PCT/EP 03/09818				Internationales Anmelde 04.09.2003	edatum (Tag/Monat/Jahr)	Prioritätsdatum (TagMonatUahr) 11.09.2002	
Inter	Internationale Patentklassifikation (IPK) oder nationale Klassifikation und IPK						
C07	C07C253/30						
Anm	elder						
DE	GUSS	SA AG	a et al.				
1.	Dies bear	ser int uftrag	ernationale vorläufige Pr ten Behörde erstellt und	üfungsbericht wurde vo wird dem Anmelder ge	on der mit der internatio mäß Artikel 36 übermit	onalen vorläufigen Prüfung ttelt.	
2.	Dies	er BE	RICHT umfaßt insgesar	nt 5 Blätter einschließl	ich dieses Deckblatts.		
				•	•	·	
	Außerdem liegen dem Bericht ANLAGEN bei; dabei handelt es sich um Blätter mit Beschreibungen, Ansprüchen und/oder Zeichnungen, die geändert wurden und diesem Bericht zugrunde liegen, und/oder Blätter mit vor dieser Behörde vorgenommenen Berichtigungen (siehe Regel 70.16 und Abschnitt 607 der Verwaltungsrichtlinien zum PCT).						
	Dies	se Anl	agen umfassen insgesa	mt 9 Blätter.			
3.	Dies	er Be	richt enthält Angaben zu	ı folgenden Punkten:			
	l	$\boxtimes$	Grundlage des Besche	eids		•	
	II		Priorität			+ a*	
	III 🔲 Keine Erstellung eines Gutachtens über Neuheit, erfinderische Tätigkeit und gewerbliche Anwendbark			keit und gewerbliche Anwendbarkeit			
	IV		Mangelnde Einheitlich	langelnde Einheitlichkeit der Erfindung		<i>*</i>	
	V M Begründete Feststellung nach Regel 66.2 a)ii) hinsichtlich der Neuheit, der erfinderischen T\u00e4tigkeit und der gewerblichen Anwendbarkeit; Unterlagen und Erkl\u00e4rungen zur St\u00fctzung dieser Feststellung			eit, der erfinderischen Tätigkeit und der zung dieser Feststellung			
	VI		Bestimmte angeführte	Unterlagen			
	VII		Bestimmte Mängel der	r internationalen Anmeldung			
İ	VIII   Bestimmte Bemerkungen zur internationalen Anmeldung		•				
					1		
j Datu	ım der	Einrei	chung des Antrags		Datum der Fertigstellun	ng dieses Berichts	
19.	02.20	04			12.01.2005		
	ne und uftragle		nschrift der mit der internati lörde	onalen Prüfung	Bevollmächtigter Bedie	nsteter	
Europäisches Patentamt				Com A			
!	<i>(()</i>	Те	80298 München I. +49 89 2399 - 0 Tx: 5236	56 epmu d	Sen, A		
i	Fax: +49 89 2399 - 4465		Tel. +49 89 2399-8328	Police onloge			

# INTERNATIONALER VORLÄUFIGER PRÜFUNGSBERICHT

Internationales Aktenzeichen PCT/EP 03/09818

I. Grundlage	des Berichts
--------------	--------------

1. Hinsichtlich der **Bestandteile** der internationalen Anmeldung (*Ersatzblätter*, die dem Anmeldeamt auf eine Aufforderung nach Artikel 14 hin vorgelegt wurden, gelten im Rahmen dieses Berichts als "ursprünglich eingereicht" und sind ihm nicht beigefügt, weil sie keine Änderungen enthalten (Regeln 70.16 und 70.17)):

	Beso	chreibung, Seiten	·					
	2, 8-	10	in der ursprünglich eingereichten Fassung					
	1, 3,	4, 5, 5a, 6, 7	eingegangen am 01.09.2004 mit Schreiben vom 01.09.2004					
		prüche, Nr.	ot 00 0004 mit Sahraihan yam 01 09 2004					
	1-9		eingegangen am 01.09.2004 mit Schreiben vom 01.09.2004					
2.	die i	nternationale Anmeld	Alle vorstehend genannten Bestandteile standen der Behörde in der Sprache, in der ung eingereicht worden ist, zur Verfügung oder wurden in dieser eingereicht, sofern anderes angegeben ist.					
	Die l eing	Bestandteile standen ereicht; dabei handelt	der Behörde in der Sprache: zur Verfügung bzw. wurden in dieser Sprache es sich um:					
		(nach Regel 23.1(b))						
☐ die Veröffentlichungssprache der internationalen Anmeldung (nach Regel 48.3(b)).								
		die Sprache der Übersetzung, die für die Zwecke der internationalen vorläufigen Prüfung eingereicht worden ist (nach Regel 55.2 und/oder 55.3).						
3.	Hins inte	linsichtlich der in der internationalen Anmeldung offenbarten <b>Nucleotid- und/oder Aminosäuresequenz</b> ist di nternationale vorläufige Prüfung auf der Grundlage des Sequenzprotokolls durchgeführt worden, das:						
		in der internationalen Anmeldung in schriftlicher Form enthalten ist.						
		$\square$ zusammen mit der internationalen Anmeldung in computerlesbarer Form eingereicht worden ist.						
	<ul> <li>□ bei der Behörde nachträglich in schriftlicher Form eingereicht worden ist.</li> <li>□ bei der Behörde nachträglich in computerlesbarer Form eingereicht worden ist.</li> </ul>							
		to the state of th						
		<ul> <li>Die Erklärung, daß die in computerlesbarer Form erfassten Informationen dem schriftlichen Sequenzprotokoll entsprechen, wurde vorgelegt.</li> </ul>						
<ol> <li>Aufgrund der Änderungen sind folgende Unterlagen fortgefallen:</li> </ol>								
		Beschreibung,	Seiten:					
		Ansprüche,	Nr.:					
		Zeichnungen,	Blatt:					
		_						

# INTERNATIONALER VORLÄUFIGER PRÜFUNGSBERICHT

Internationales Aktenzeichen . PCT/EP 03/09818

5. Dieser Bericht ist ohne Berücksichtigung (von einigen) der Änderungen erstellt worden, da diese aus den angegebenen Gründen nach Auffassung der Behörde über den Offenbarungsgehalt in der ursprünglich eingereichten Fassung hinausgehen (Regel 70.2(c)).

(Auf Ersatzblätter, die solche Änderungen enthalten, ist unter Punkt 1 hinzuweisen; sie sind diesem Berichtbeizufügen.)

- 6. Etwaige zusätzliche Bemerkungen:
- V. Begründete Feststellung nach Artikel 35(2) hinsichtlich der Neuheit, der erfinderischen Tätigkeit und der gewerblichen Anwendbarkeit; Unterlagen und Erklärungen zur Stützung dieser Feststellung
- 1. Feststellung

Neuheit (N) Ja: Ansprüche 1-9

Nein: Ansprüche

Erfinderische Tätigkeit (IS) Ja: Ansprüche 1-9

Nein: Ansprüche

Gewerbliche Anwendbarkeit (IA) Ja: Ansprüche: 1-9

Nein: Ansprüche:

2. Unterlagen und Erklärungen:

siehe Beiblatt

US-A-3 567 758 D1:

TETRAHEDRON, Bd. 39, Nr. 1, 1983, Seiten 193-197 D2:

GB-A-1 065 936 D3: GB-A-1 442 250

#### Zu Punkt V

Begründete Feststellung hinsichtlich der Neuheit, der erfinderischen Tätigkeit und der gewerblichen Anwendbarkeit; Unterlagen und Erklärungen zur Stützung dieser Feststellung

Die vorliegende Anmeldung erfüllt das in Artikel 33(2) PCT genannte Kriterium, weil der Gegenstand der Ansprüche neu ist.

Die Anmeldung betrifft ein Verfahren zur Katalysator-freien Herstellung von Cyanophenolen aus Methoxybenzonitrile mit einem Alkalialkoholat bei Temperaturen zwischen 80 und 230°C.

Im Gegensatz dazu offentbart D1 ein Verfahren, bei dem z.B. (Beispiel 1 von D1) 4-Methoxybenzonitril mit Natriumphenolat umgesetzt wird.

Die vorliegende Anmeldung erfüllt das in Artikel 33(3) PCT genannte Kriterium, weil der Gegenstand der Ansprüche auf einer erfinderischen Tätigkeit beruht.

Aufgabe der Anmeldung ist "ein Verfahren zur Katalysator-freien Herstellung von Cyanophenolen zu entwickeln, das die umweltfreundliche und abfallarme Herstellung des gewünschten Produktes mit günstigen Rohstoffen in hohen Ausbeuten erlaubt" (siehe Seite 6, Zeilen 1-5).

Gelöst wurde diese Aufgabe mit einem entsprechendem Verfahren, wobei das substituierte Methoxybenzonitril der allgemeinen Formel (I) mit einem Alkalialkoholat bei Temperaturen zwischen 80° und 230°C umgesetzt wird.

D1 wird als nächstliegenden Stand der Technik angesehen. Wie oben bereits dargelegt, offenbart D1 ein Verfahren unter Verwendung von Natriumphenolat. Diese Verwendung von Phenolaten anstelle von Alkoholaten hat folgende Nachteile: "Phenolate sind erheblich teurer als Alkoholate, beim Einsatz von Phenolaten als Koppelprodukte fallen sehr große Abfallmengen an Phenolethern an, die darüber hinaus nicht stofflich genutzt werden können" (Brief des Anmelders vom 01.09.04, Seite 3, "Zur erfinderischen Tätigkeit", Absatz 2).

Aus D1 kann man die Verwendung von Phenolaten nicht ohne Weiteres auf Alkoholate übertragen werden.

D2 offenbart die Reaktion von Dichlorobenzolen mit Natriummethoxid, wobei die entsprechenden Chloranisole entstehen. An keiner Stelle von D2 ist erwähnt, dass das dort offenbarte Verfahren auch auf andere substituierte Aromaten, wie beispielsweise



Internationales Aktenzeichen PCT/EP 03/09818

Nitrile, ausgeweitet werden kann. Da D2 sich ausschließlich mit halogenierten und insbesondere chlorierten Phenolen befaßt, ohne dabei Nitrile oder Cyanophenole zu erwähnen, hätte der Fachmann keine Veranlassung gehabt, das Dokument D2 mit dem Dokument D1 zu kombinieren.